

Abstract of JP 2002255793

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a granular pharmaceutical preparation comprising a water- soluble drug ingredient (liquid or powdery), especially a raw material assuming an unfavorable flavor at a high concentration and prepared by a liquid dropping method. SOLUTION: This granular pharmaceutical preparation is obtained by dissolving or suspending and mixing a liquid or a powdery water-soluble drug ingredient at a concentration of ≥ 10 wt.% in a gelling agent and granulating the resultant solution or suspension by the liquid dropping method.

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2002-255793

(P2002-255793A)

(43)公開日 平成14年9月11日 (2002.9.11)

(51)Int.Cl.⁷

A 61 K 9/14

識別記号

F I

A 61 K 9/14

テ-マコ-ト^{*}(参考)

4 C 0 7 6

審査請求 未請求 請求項の数 3 O L (全 4 頁)

(21)出願番号 特願2001-54297(P2001-54297)

(22)出願日 平成13年2月28日 (2001.2.28)

(71)出願人 000191755

森下仁丹株式会社

大阪府大阪市中央区玉造1丁目1番30号

(72)発明者 植木 利也

大阪府大阪市中央区玉造1丁目1番30号

森下仁丹株式会社内

(72)発明者 西野 由貴江

大阪府大阪市中央区玉造1丁目1番30号

森下仁丹株式会社内

(74)代理人 100062144

弁理士 青山 葵 (外1名)

最終頁に統く

(54)【発明の名称】 粒状製剤

(57)【要約】

【課題】 水溶性薬剤成分(液状、粉末状)、特に好ましくない風味を呈する原料を高濃度に含有する、液滴下法により得られた粒状製剤の提供。

【解決手段】 液状または粉末状水溶性薬剤成分をゲル化剤中に10重量%以上の濃度で溶解または懸濁混合し、液滴下法により粒状化した粒状製剤。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 液状または粉末状水溶性薬剤成分をゲル化剤中に10重量%以上の濃度で溶解または懸濁混合し、液滴下法により粒状化した粒状製剤。

【請求項2】 上記水溶性薬剤成分が好ましくない風味を呈する物質である請求項1記載の粒状製剤。

【請求項3】 多層構造を有する、請求項1記載の粒状製剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、水溶性薬剤成分原料（液状、粉末状）、特に好ましくない風味を呈する原料を含有する製剤に関し、主剤を高濃度に含有させながらマスキング効果を得ること、およびマスキングのための賦形剤の削減に関する。

【0002】

【従来の技術】水溶性薬剤成分原料の固形製剤化においては流動層造粒法、湿式押し出し造粒法、乾式破碎造粒法による造粒化およびこれらの造粒物による打錠化が採り入れられている。エキス原料は吸湿性が高く、エキス含有率の高い造粒には練合液にエタノール等の有機溶媒の使用、打錠には多量の賦形剤を必要とする。特開平5-95988号公報にはエキス末と賦形剤よりなる混合物を浮遊旋回流動させ、高濃度にエキス粉末を含有する造粒物の製造方法が開示されている。しかし、この製法における賦形剤は合成ケイ酸アルミニウムを使用しており、食品に用いることができない。

【0003】食品においては不快な味を呈する原料に対し、甘味料等を含む賦形剤を用いて打錠又は打錠品をシェラック等でコーティングする製法が一般的であるが、十分にマスキングするために賦形剤および服用量が増加する。好ましくない風味を呈する原料に対し口中での不快な味をマスキングするために包接化合物を添加する方法（特開平3-236316号公報）、胃溶性高分子、腸溶性高分子、ワックス類等で被覆を施す方法（特開昭57-58631号、特開平3-130214号公報、特開平5-255075号公報、特開平11-349473号公報）が開示されているが食品に適用できる被包材や添加量は限られており、十分なコーティングを得ようとすれば被覆剤特有の服用時のザラつき感が生じる。アスパルテーム等の甘味料や香辛料を添加する方法（特開平2-56416号公報）においても不快な味が強い場合は、マスキングは不可能である。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】従って、本発明の目的は、水溶性薬剤成分原料（液状、粉末状）および好ましくない風味を呈する原料を含有する製剤に関し、食品に

広く利用できる方法で主剤を重量10%濃度以上に含有させながらマスキング効果を得ること、およびマスキングのための賦形剤の削減に関する。

【0005】

【課題を解決するための手段】かかる実情において本発明者らは、鋭意検討を行った結果、水溶性薬剤成分原料（液状、粉末状）および好ましくない風味を呈する原料（重量10%～90%濃度）にゼラチンを主成分とした皮膜剤（水溶性薬剤成分に対し重量10～90%濃度、好ましくは重量30%濃度程度）、必要により水を加えて加熱溶解した皮膜溶液を調製、液滴下法、冷却、脱油、乾燥、洗浄の工程により粒状製剤とするに至った。

【0006】本発明における水溶性薬剤成分原料は、植物抽出エキスの他、通常、食品に使用されている原料であればどのようなものでもよい。例えば、茶抽出物、果汁、飲料等が使用できる。ただし、本発明は上記の原料に限定されるものではない。

【0007】本発明における好ましくない風味を呈する原料は、植物抽出エキスの他、通常、食品や健康食品に使用されている原料であればどのようなものでもよい。例えば、動物性抽出物（液体・固体）、水溶性ビタミン等が使用できる。ただし、本発明は上記の原料に限定されるものではない。

【0008】本発明の水溶性薬剤成分原料使用量および好ましくない風味を呈する原料（重量10%～90%濃度）であるが、原料の形態および種類、使用目的に応じ、必ずしもこの範囲に限定されない。

【0009】本発明におけるゲル化剤はゼラチンを主成分としているが、液滴下法において皮膜に添加されるものであれば主成分の添加量を超えてどのようなものを添加してもよい。例えばソルビトール、グリセリンが添加できる。ただし、本発明は上記の原料に限定されるものではない。液滴下法は、特公昭51-8875号公報に記載されるシームレスカプセルの製法をいう。

【0010】

【実施例】本発明の実施例によってさらに具体的に説明するが、これらは発明の範囲を限定するものではない。

【0011】実施例1

表1中の原料の内、マッシュルームエキス、植物抽出エキス末、ソルビトール、水を混合溶解した溶液にゼラチンを少量ずつ添加しよく混合加温溶解した。この溶液をシームレスカプセルのカプセル製剤機を用い、液滴下法により粒状物を得、冷却、脱油、ドラム乾燥、洗浄の工程を経て粒径1.8mmの造粒物を得た。

【0012】

【表1】

原料	配合比 (%)	備考
マッシュルームエキス	100.0	固形分濃度 36%
植物抽出エキス末	10.0	
ゼラチン	35.0	
ソルビトール	19.0	
水	36.0	
合計	200.0	
固形分合計	100.0	

【0013】試験例1

従来の処方（表2）による製剤性の違いを比較した。表2中のエリスリトール、マッシュルームエキス末、有機酸、香料をニーダーに投入混合後、水、エタノールを添加混合し、1.5 mmのスクリーンをついた押し出し造粒機で造粒し、静置乾燥により60°C 3時間の乾燥を行い、粒径約1.5 mmの顆粒を得た。押し出し造粒においては液状エキスの添加量には製剤性の理由から制限があり、高濃度の含有にはエキス末の使用となる。エキス末10%濃度の製剤において、不快な味が強くマスキングは不可能であった。

【0014】先の実施例の造粒では、乾燥の工程でマッシュルームエキス中の水分を乾燥させるため、造粒物に対し、100%重量のエキスを含有させることができ、不快な味を呈するエキス末を同時に添加することも可能であった。

【0015】また、実施例では顆粒に比べて口溶けが遅く、ゼラチンで包括されているため味のマスキング効果が認められた。

原料	配合比 (%)	備考
(I液)		
マッシュルームエキス	100.0	固形分濃度 36%
植物抽出エキス末	10.0	
ゼラチン	20.0	
ソルビトール	4.0	
水	4.0	
小計	140.0	
固形分合計	70.0	
(II液)		
ゼラチン	15.0	
ソルビトール	15.0	
水	30.0	
合計	60.0	
固形分合計	30.0	
固形分合計	100.0	

【0019】試験例2

実施例1との製剤性およびマスキング効果について比較を行った。実施例1および2において、乾燥の工程でマッシュルームエキス中の水分を乾燥させるため、造粒物に対し、100%重量のエキスを含有させることができ、不快な味を呈するエキス末を同時に添加することも可能であった。

【0020】また、実施例1、2ではマッシュルームエキスおよび不快な味を呈するエキス末の含有量は造粒物あたりに対し同量であったが、実施例2においてマスキング効果がより高められた。

【0016】

【表2】表2

原料	配合比 (%)
マッシュルームエキス末	10.0
エリスリトール	87.0
有機酸	2.0
香料	1.0
エタノール	8.0
水	2.0
固形分合計	100.0

【0017】実施例2

表3中の原料の内、I液中のマッシュルームエキス、植物抽出エキス末、ソルビトール、水を混合溶解した溶液にゼラチンをを少量ずつ添加しよく混合加温溶解した。またII液についても同様に混合加温溶解を行い、この2つの溶液をシームレスカプセルのカプセル製剤機で2重ノズルを用い、液滴下法により粒状物を得、冷却、脱油、ドラム乾燥、洗浄の工程を経て粒径1.8 mmの造粒物を得た。

【0018】

【表3】表3

原料	配合比 (%)	備考
(I液)		
マッシュルームエキス	100.0	固形分濃度 36%
植物抽出エキス末	10.0	
ゼラチン	20.0	
ソルビトール	4.0	
水	4.0	
小計	140.0	
固形分合計	70.0	
(II液)		
ゼラチン	15.0	
ソルビトール	15.0	
水	30.0	
合計	60.0	
固形分合計	30.0	
固形分合計	100.0	

【0021】

【発明の効果】本発明により、食品に広く利用できる方法で、水溶性薬剤成分含有製剤および好ましくない風味を呈する原料を高濃度に含有させながら、味のマスキングを達成し、従来マスキングのために必要であった賦形剤の削減を達成することができる。この結果、従来水溶性薬剤成分や好ましくない風味を呈する原料を高濃度に含有する食品の摂取において課題であった、味のマスキング、飲みにくさ、全体量の多さ等の欠点についても改善することができる。

フロントページの続き

(72)発明者 壬生 祥文
大阪府大阪市中央区玉造1丁目1番30号
森下仁丹株式会社内

F ターム(参考) 4C076 AA31 AA39 BB01 CC50 DD38T
EE42P FF35 FF52 GG10